出願人又は代理人 の書類記号 OI 今後の手続きについては、様式PCT/IPEA/416を参照すること。

PCT

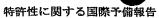
特許性に関する国際予備報告(特許協力条約第二章)

(法第12条、法施行規則第56条) [PCT36条及びPCT規則70]

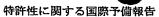
ONF-4928PCT

				١
REC'D	0,7	APR	2005	
WIPO	··		PCT	

1	祭出願日 .月.年) 05.	03.	2004	優先日 (日.月.年)	06.0	3.	2003
国際特許分類 (IPC) Int. Cl ⁷ C07D209/26, 401/12, 403/12, 405/12, 409/12, 411/12, 413/06, 413/12, 413/14, A61K31/405, 31/422, 31/423, 31/4439, 31/4709, 31/538, 45/06, A61P1/04, 1/16, 7/00, 7/02, 9/00, 11/00, 11/02, 11/06, 11/08,							
出願人(氏名又は名称) ・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・	C 会社			· · · · · · · · · · · · · · · · · · ·			
1. この報告書は、PCT35条に基づきこの 法施行規則第57条 (PCT36条) の規			された国際	予備審査報告で	ある。		
2. この国際予備審査報告は、この表紙を含む	かて全部で	7	ページ	からなる。			
3. この報告には次の附属物件も添付されている。 附属書類は全部で		• .					
補正されて、この報告の基礎と 囲及び/又は図面の用紙(PC					を含む明	細書、	請求の範
		おける国	際出願の開え	示の範囲を超え	た補正を	含むも	っのとこの
b 電子媒体は全部で 配列表に関する補充欄に示すよう ブルを含む。(実施細則第802		読み取り	可能な形式				を示す)。 重するテー
4. この国際予備審査報告は、次の内容を含む	tr.				· · · · · · · · · · · · · · · · · · ·		
 図 第 I 概 国際予備審査報告の 第 II 概 優先権 図 第 II 概 頻 類 規性、進歩性又は 第 IV 概 発明の単一性の欠如 図 第 V 概 P C T 3 5 条 (2) にけるための文献及び 図 第 VI 概 ある種の引用文献 財 類 1 個 国際出願の不備 図 第 1 概 国際出願に対する意 	は産業上の利用可能 ロ 規定する新規性、 ド説明					上解、 4	それを裏付
国際予備審査の請求書を受理した日 25.05.2004	·	国際予備	審査報告を	作成した日 22.03.2	005		
名称及びあて先 日本国特許庁 (IPEA/JP) 郵便番号100-8915 東京都千代田区霞が関三丁目4番3	号		中木	のある職員) 亜希 581-110	1 内紙	4 P	9282



第1欄 報告の基礎	·		
1. この国際予備審査報告は、	下記に示す場合を除くほか	、国際出願の官語を基礎と	とした。
それは、次の目的で援 PCT規則12.3及 PCT規則12.4に PCT規則55.2又	(は55.3にいう国際予備審査	5.	
2. この報告は下記の出願書 た差替え用紙は、この報告に			- 基づく命令に応答するために提出され
X 出願時の国際出願書	類		
明細書 第 第 第 第	ページ、 ページ*、 ページ*、	出願時に提出されたもの f	けで国際予備審査機関が受理したもの けけで国際予備審査機関が受理したもの
請求の範囲第第第第第			づき補正されたもの 付けで国際予備審査機関が受理したもの 付けで国際予備審査機関が受理したもの
図面 第 第 第 第 第 配列表又は関連する 配列表に関する	ページ/図*、 ページ/図*、		付けで国際予備審査機関が受理したもの 付けで国際予備審査機関が受理したもの
3. 補正により、下記の 明細書	審類が削除された。 第 <u></u> 第		ページ 頃 ページ/図
	第 けに記載すること) ⁻るテーブル(具体的に記載 [~]		ハーシ/図
えてされたものと認 明細書 簡求の範囲 図面 配列表(具体的		されなかったものとして作。 	た補正が出願時における開示の範囲を超成した。 (PCT規則70.2(c)) ページ ほージ/図
* 4. に該当する場合、そ	の用紙に"superseded"と記	己入されることがある。 `	



第Ⅱ	
	火に関して、当該請求の範囲に記載されている発明の新規性、進歩性又は産業上の利用可能性につき、次の理由により 審査しない。
	国際出願全体
X	請求の範囲
選申	: この国際出願又は請求の範囲 <u>22</u> は、国際予備審査をすることを要しない 次の事項を内容としている(具体的に記載すること)。 請求の範囲22に記載された発明は、治療による人体の処置方法に関するもので
	ある。
	明細書、請求の範囲若しくは図面(次に示す部分)又は請求の範囲の記載が、不明確であるため、見解を示すことができない(具体的に記載すること)。
	全部の請求の範囲又は請求の範囲
X	請求の範囲 22 について、国際調査報告が作成されていない。
	ヌクレオチド又はアミノ酸の配列表が、実施細則の附属書C(塩基配列又はアミノ酸配列を含む明細書等の作成のため のガイドライン)に定める基準を、次の点で満たしていない。
	街面による配列表が一 提出されていない。□ 所定の基準を満たしていない。
	コンピュータ読み取り可能な形式による配列表が 提出されていない。 所定の基準を満たしていない。
	コンピュータ読み取り可能な形式によるヌクレオチド又はアミノ酸の配列表に関連するテーブルが、実施細則の附属各 Cの2に定める技術的な要件を、次の点で満たしていない。
	□ 提出されていない。 □ 所定の技術的な要件を満たしていない。
1	詳細については補充欄を参照すること。

様式PCT/IPEA/409 (第Ⅲ欄) (2004年1月)

2. 文献及び説明 (PCT規則70.7)

文献1:WO 01/66520 A1 本国際出願の一般式(I)で示される化合物と重複する化合物がDP受容体拮抗 剤であり、アレルギー疾患に有効であることが示されている。

文献2:EP 1170594 A2 本国際出願の一般式(I)で、D-R1:CH2COOH、R2:メチル基、R 3:フッ素、A:メチレン、ring1:ベンゾチアゾール、R4:水素原子、R 5:水素原子 の化合物が記載されている(本国際出願第4頁上部に、斯かる化合 物の構造式が示されている。)。

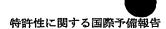
*請求の範囲:1-21,23

請求の範囲第1-21項及び第23項に記載の発明は、文献1に対して新規性、

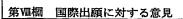
進歩性を、文献2に対して進歩性を有しない。

文献1には、本願発明に係る化合物がCRTH2受容体拮抗作用を有することは 示されていないが、DP受容体拮抗剤でありアレルギー疾患に有効であることが示 されているのだから、本願発明の内容と区別をすることができないものである。

また、文献2に記載の化合物と本国際出願に係る化合物とは、後者(本国際出願の化合物)が本国際出願の一般式(I)でR5を有する点でのみ相違するものである。しかしながら、作用が知られた化合物に各種の置換基を付与した化合物を製造し作用を検討することは、当該技術分野で普通に行われることであり、また、本願発明に係る化合物が文献2に記載の化合物と比較して予想外の格別顕著な効果を奏するものとも認めることができないので、本願発明の進歩性を認めることができない。



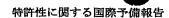
	出願番号	公知日	出願日	優先日(有効な優先権の主
	特許番号	(日.月.年)	(日.月.年)	(日. 月. 年)
WO 03/	022813 A1 [EX]	20. 03. 2003	06. 09. 2002	07. 09. 2001
•				
•				
		(日.月.年)		書面の日付(日.月.年)
 		(日. 月. 年)		書面の日付(日.月.年)
		(日.月.年)		書面の日付(日. 月. 年)
	·	(日. 月. 年)		書面の日付(日. 月. 年)
	·	(日. 月. 年)		書面の日付(日. 月. 年)
·		1		
		1		



請求の範囲、明細書及び図面の明瞭性又は請求の範囲の明細書による十分な裏付についての意見を次に示す。

請求の範囲1は、非常に多数の化合物を包含している。しかしながら、PCT第6条の意味において明細書に裏付けられ、また、PCT第5条の意味において開示されているのは、クレームされた化合物のごくわずかな部分にすぎない。よって、この国際予備審査報告は、明細書に裏付けられ、開示されている部分、すなわち、実施例を中心に作成した。

請求の範囲において、「プロドラッグ」と記載するものであるが、その範囲が不明 瞭である。



補充欄

いずれかの棚の大きさが足りない場合

国際特許分類(IPC)の続き

Int. Cl⁷ A61P17/00, 17/04, 17/10, 19/02, 25/06, 25/20, 27/02, 27/12, 27/14, 27/16, 29/00, 37/02, 37/06, 37/08, 43/00

Translation

PATENT COOPERATION TREATY



PCT

INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT ON PATENTABILITY (Chapter II of the Patent Cooperation Treaty)

(PCT Article 36 and Rule 70)

					
Applicant's or agent's file reference ONF-4928PCT	FOR FURTHER A	CTION	See Form PCT/IPEA/416		
· · · · · · · · · · · · · · · · · · ·		ate (day/month/year)	Priority date (day/month/year)		
PCT/JP2004/002813	05 March 200	4 (05.03.2004)	06 March 2003 (06.03.2003)		
International Patent Classification (IPC) or n	national classification ar	nd IPC			
Applicant					
• •	ONO PHARMACE	UTICAL CO., LT	D.		
This report is the international prelin Authority under Article 35 and trans	minary examination repsmitted to the applicant	ort, established by this according to Article 3	s International Preliminary Examining 6.		
2. This REPORT consists of a total of			sheet.		
3. This report is also accompanied by A					
a (sent to the applicant and	to the International Bu	reau) a total of	sheets, as follows:		
sheets of the desc and/or sheets con Administrative In	taining rectifications au	rawings which have be thorized by this Autho	een amended and are the basis of this report ority (see Rule 70.16 and Section 607 of the		
sheets which super beyond the disclored Supplemental Box	sure in the international	at which this Authority al application as filed,	considers contain an amendment that goes as indicated in item 4 of Box No. I and the		
b. (sent to the Internation	nal Bureau only) a, contai ndicated in the Supplen	ining a sequence listin	pe and number of electronic carrier(s)) g and/or tables related thereto, in computer o Sequence Listing (see Section 802 of the		
4. This report contains indications relat	ting to the following ite	ms:			
Box No. I Basis of the re	port				
Box No. II Priority					
Box No. III Non-establish	ment of opinion with re	gard to novelty, invent	tive step and industrial applicability		
Box No. IV Lack of unity	of invention				
Box No. V Reasoned state citations and e	ement under Article 35(explanations supporting	2) with regard to nove such statement	lty, inventive step or industrial applicability;		
Box No. VI Certain docum					
Box No. VII Certain defects	s in the international ap	plication			
Box No. VIII Certain observ	ations on the internation	nal application			
Date of submission of the demand		Date of completion o	of this report		
25 May 2004 (25.05.2	004)	-	March 2005 (22.03.2005)		
Name and mailing address of the IPEA/JP		Authorized officer			
Facsimile No.		Telephone No.			

INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT ON PATENTABILITY

Box No	. I	Basis of the report
1. With other	regare rwise i	d to the language, this report is based on the international application in the language in which it was filed, unless indicated under this item.
	This whi	s report is based on translations from the original language into the following language, the is language of a translation furnished for the purpose of:
]		international search (under Rules 12.3 and 23.1(b))
		publication of the international application (under Rule 12.4)
		international preliminary examination (under Rules 55.2 and/or 55.3)
1 /4///	are not	rd to the elements of the international application, this report is based on (replacement sheets which have been to the receiving Office in response to an invitation under Article 14 are referred to in this report as "originally filed" international application as originally filed international application as originally filed for international application.
		international application as originally filed/furnished
		description:
	pages	, as originally fried/furnished
]	pages	1000110d by and radiotry on
		1000 Fed by this Additing on
		laims:
	pages	, as originally filed/furnished
	pages	, as amended (logether with any statement) under Article 19
1	pages	Teceived by this Additivity on
		toosived by this Additiontly on
		rawings:
	pages	, as originally filed/furnished
]	pages pages	1 received by this Authority on
],		- Secretary and Adminity on
	a sequ	uence listing and/or any related table(s) - see Supplemental Box Relating to Sequence Listing.
3	The a	amendments have resulted in the cancellation of:
		the description, pages
		the claims, Nos.
		the drawings, sheets/figs
		the sequence listing (specify):
ļ		any table(s) related to sequence listing (specify):
4.	(Rule	report has been established as if (some of) the amendments annexed to this report and listed below had not been since they have been considered to go beyond the disclosure as filed, as indicated in the Supplemental Box of 70.2(c)).
		the claims. Nos
		the drawings sheets/fire
		the drawings, sheets/figs
		the sequence listing (specify):
!		any table(s) related to sequence listing (specify):
* If item	1 4 app	plies, some or all of those sheets may be marked "superseded."

INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT ON PATENTABILITY



Box No.	ın	Non-establishment of opinion	with r	egard	to nove	elty, i	nventi	ve step	and ind	dustr			lity		
The que	estions	as whether the claimed invention ave not been examined in respect	appears											be indus	strially
	the	e entire international application.	•												
\boxtimes	cla ⁱ	sim No2	22												
becau	ıse:														
\boxtimes	the rela	e said international application, o late to the following subject matte	ter which	ch does	s not req	quire a	an inter	-nation	al prelim	22 ninary	exami	nation	(enecify	<u> </u>	
Τ	he i	invention of claim 22 cor	ncerns	s a m	ethod	for	treati	ng th	e hum	an t	ody ł	ov th	رهامره) .eranv	/.	
•															
	the are	e description, claims or drawings e so unclear that no meaningful of	(indicat	te part.	icular e	elemen ed (sp	nts belo vecify):	ow) or	said clai	ms N	os				
	the o	claims, or said claims Nos	ul opini	ion cou	ıld be fo	ormed	i.				are s	so inad	lequately	/ support	ed
\boxtimes	no i	international search report has be	en estal	ıblished	d for sai	id clai	im No.				22				_•
	the r Adn	nucleotide and/or amino acid seq ministrative Instructions in that:	quence l	listing	does no	ot con	nply wi	ith the	standard	l prov	ided fo	r in Aı	nnex C o	f the	
	the v	written form		has n	not been	n furn	ished								
				does	not con	mply ,	with th	e stand	lard						
٠	the c	computer readable form		has n	not been	a furni	ished								
•				does	not con	mply v	with the	e stand	lard						
	the ta	ables related to the nucleotide an echnical requirements provided f	ıd/or am for in A	nino ac unnex (;id sequ C-bis of	ience ! f the #	listing, Admini:	, if in co	omputer e Instruct	reada tions.	able for	m onl	y, do not	: comply	with
	see S	Supplemental Box for further deta	ails.												





Box No. V Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement						
1. Statement	,					
Novelty (N)	Claims		YES			
	Claims	1-21, 23	NO			
Inventive step (IS)	Claims		YES			
	Claims	1-21, 23	NO			
Industrial applicability (IA)	Claims	1-21, 23	YES			
	Claims		NO			

2. Citations and explanations (Rule 70.7)

Document 1 (WO 01/66520 A1) discloses a compound overlapping the compound represented by General Formula (I) of this international application that is a DP receptor antagonist and is effective in the treatment of allergic disease.

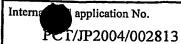
Document 2 (EP 1170594 A2) describes the compound of General Formula (I) of this international application wherein D-R1 is a CH₂COOH, R2 is a methyl group, R3 is a fluorine, A is a methylene, ring 1 is a benzothiazole, R4 is a hydrogen atom, and R5 is a hydrogen atom (The structural formula of this compound is shown on the upper part of page 4 of this international application).

*Claims 1-21 and 23

The inventions of claims 1-21 and 23 lack novelty and an inventive step with respect to document 1, and lack an inventive step with respect to document 2.

Document 1 does not disclose that the compounds of the inventions of this application have CRTH2 receptor antagonism, but because it does disclose that they are DP receptor antagonists that are effective in the treatment of allergic disease, this examination finds those compounds are indistinguishable in content from the compounds of the inventions of the present application.

In addition, when we compare the compounds described in document 2 and the compounds of this international application, the latter (the compounds of this international application) differ only from the standpoint that they include R5 in General Formula (I) of this international application. However, this examination finds that it is conventional practice in this field of technology to prepare compounds by adding various substituents to compounds with a known action and then investigating the action thereof. Moreover, when we compare the compounds of the inventions of the present application with the compounds described in document 2, this examination finds that no particularly outstanding effect is provided thereby that could not be predicted by persons skilled in the art, and therefore the inventions of this application lack an inventive step.



INTERNATIONAL PRELIM Y REPORT ON PATENTABILITY Box No. VI Certain documents cited 1. Certain published documents (Rule 70.10) Application No. Publication date Filing date Priority date (valid claim) Patent No. (day/month/year) (day/month/year) (day/month/year) WO 03/022813 A1 20.03.2003 06.09.2002 07.09.2001 [EX] 2. Non-written disclosures (Rule 70.9) Date of written disclosure Kind of non-written disclosure Date of non-written disclosure referring to non-written disclosure (day/month/year) (day/month/year)





Box No. VIII Certain observations on the international application

The following observations on the clarity of the claims, description, and drawings or on the question whether the claims are fully supported by the description, are made:

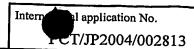
The scope of claim 1 includes an extremely broad range of compounds, but only a very small number of the claimed compounds are supported by the Description in the sense of PCT Article 6 and fully disclosed in the sense of PCT Article 5.

As a result, this international preliminary examination report was prepared focusing on the compounds that are supported and fully disclosed in the Description, i.e., the compounds in the Examples.

Moreover, the term "prodrug" is used in the claims, but the scope of that term is unclear.

INTERNATIONAL PRELIM

RY REPORT ON PATENTABILITY



Su	nn	lem	en	tal	Rox
Su:	vv.	ıcın	eп	СЯІ	KOY

In case the space in any of the preceding boxes is not sufficient.

Continuation of International Patent Classification (IPC)

Int. Cl⁷ A61P17/00, 17/04, 17/10, 19/02, 25/06, 25/20, 27/02, 27/12, 27/14, 27/16, 29/00, 37/02, 37/06, 37/08, 43/00